

БИОЛОГИЧЕСКАЯ АКТИВНОСТЬ НОВЫХ ПРОИЗВОДНЫХ АМИНОБЕНЗИМИДАЗОЛА

Рупакова Н.А., Слесарев Г.П., Алексеева К.А., Березкина Т.В.

Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

Недавние исследования 2-замещенных бензимидазолов, а именно введение в молекулу различных гетероциклов в 2-положении, позволили получить мощные противоопухолевые агенты на различных клеточных линиях карциномы. Ранее нами был разработан простой и эффективный трехстадийный метод синтеза сульфонамидинов **4,5**, позволяющий проводить синтез в мягких условиях и с хорошими выходами (Схема 1).

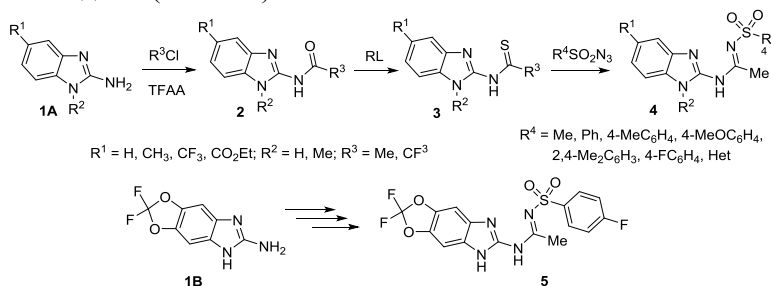


Схема 1. Синтез сульфонамидинов

Синтезированные в ходе выполнения работы сульфонацетамидины **4,5** и тиамины **3** протестированы на эффективность ингибирования киназы и роста линий опухолевых клеток глиобластомы. Выявлены вещества, проявляющие умеренную активность к ингибированию СК1δ и СК1α. Также проведены МТТ тесты на клеточных линиях, показывающие перспективные значения IC 50 тиаминов бензимидазольного ряда. Испытания на противоопухолевую активность показали необходимость введения арильной группы в молекулу бензимидазола (Схема 2).

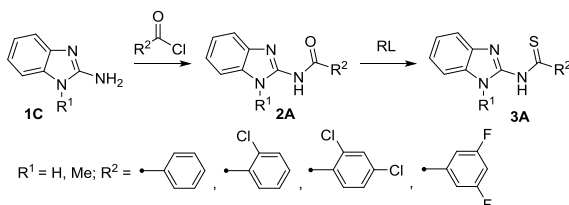


Схема 2. Синтез тиаминов **3A**

Строение всех соединений подтверждено данными ^1H , ^{13}C и 2D HSQC и HMBSC (^1H – ^{13}C) спектроскопии и масс-спектрометрии.

Работа выполнена при финансовой поддержке РФФИ (грант № 18-03-00715).